

现代精细化学化工产品技术大全

钱旭红 莫述诚 主编

科学出版社

2001

内 容 简 介

本书广泛和系统地介绍了现代精细化学化工主要产品的性能特征、制备方法和配方、应用实例和使用方法。内容包括医药、农业、食品、染料、涂料、纺织、黏合剂、表面活性剂、高分子材料、催化剂、石油工业、电子工业、信息材料、环境保护和与生命体相关的化学用品等,共18篇。本书特点是内容丰富,资料齐全,实用性强;收集了最基本、最重要、最现代化和最精确的知识和信息,是一部实用的不可多得的工具书。为便于读者查阅,书末还分别附有中文、英文索引。

本书可供从事化学工业及精细化学品研究和开发的院所、设计部门、生产单位以及工厂、企业、个体劳动者等各类人员使用,还可供高等院校有关师生教学或科研使用,也可供其他相关行业人员参考。

图书在版编目(CIP)数据

现代精细化学化工产品技术大全/钱旭红、莫述诚主编.-北京:科学出版社,2001.

ISBN 7-03-007865-9

I. 现… II. ①钱…②莫… III. 精细化工-化工产品-技术-手册
IV. TQ064-62

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (1999) 第 41261 号

科学出版社 出版

北京东黄城根北街16号
邮政编码:100717

新蕾印刷厂印刷

科学出版社发行 各地新华书店经销

*

2001年7月第 一 版 开本: 787×1092 1/16

2001年7月第一次印刷 印张: 55 1/4

印数: 1—2 200 字数: 1 936 000

定价: 120.00 元

(如有印装质量问题,我社负责调换〈杨中〉)

前 言

精细化工是相对于重化工而言的。所谓重化工，即重型化学工业，一般是指传统的硫酸、盐酸、硝酸、合成氨、无机盐、氯碱工业和基本有机合成工业等的总称。随着科学技术的不断发展和人类生活质量的日益提高，对化学工业产品的多样化，提出了越来越高的要求，化学工业的范围也随之而迅速扩展。于是，由传统的化工产品，又衍生出许多新的化工产品。这些产品的特点是涉及面广、实用性强、品种繁多、技术高度密集、经济上有很高的附加价值；20 世纪 60 年代初，在发达国家已形成了相当活跃的产业体系，通称为精细化学品工业，简称精细化工。

精细化学品工业的界定，至今尚无十分一致的权威性约定。许多国家业已出版的有关精细化工的专著、手册、刊物等，内容也有所差异。在有些国家，精细化学品仍包含于化学工业产品之中。然而这并不影响该产业体系的迅速发展，因为从科学技术、生产发展和市场需求等方面观察，精细化学品生产已经在化学工业中占有相当大的比重。在某些发达国家，精细化学品的产值已经占化学工业总产值的 60% 左右。由于精细化工与国民经济各部门和人民日常生活密切相关，它实际上已经成为化学工业的一个重要分支和国民经济生产中不可缺少的组成部分。在精细化工领域中，世界各国正竞相研究高新科技产品和制备工艺，是化学工业发展的战略重点，也是国际市场激烈竞争的焦点。

我国的精细化工，与某些发达国家相比，还存在较大差距。精细化学品的产值在化工产品总产值中所占的比重仅为某些发达国家的一半，产品种类仅为某些发达国家的三分之一左右。生产工艺、设备和产品检测手段等方面的高新科技含量都还比较低。这种状况，不仅使我国不得不耗费大量外汇以进口某些必需的产品，而且直接制约了许多相关产业的发展。

我国化学工业将发展精细化工列为“九五”计划的战略重点之一，通过优先发展精细化工，促进化学工业技术水平上一个新台阶。在跨入新世纪之际，我们撰写此书，希望能对我国精细化工的发展尽一份绵薄之力。

本书的编写宗旨是：力求介绍最基本的、最重要的、最现代的和最精确的知识和信息。由于精细化工范围的界定不尽相同，品种齐全是相对的，但希望不遗漏主要内容。本书能适应多种行业的需要，是一部便于查阅、十分实用的工具书。

本书由华东理工大学、北京工商大学和大连理工大学的有关专家协力完成，共 18 篇。全部内容是在编委会指导下精心选取和编写的，各篇撰写人如下：第一篇，杨尚金；第二篇，钱旭红、徐晓勇、张荣、李忠；第三篇，沈永嘉、董黎霄、陈焕林；第四篇，苏建华；第五篇，徐宝财；第六篇，姚胜；第七、八、十一篇，常继东；第九篇，李维格、包华；第十篇，何斌；第十二篇，薛仲华、张又文；第十三篇，莫述诚、施印华、莫华；第十四篇，田禾；第十五篇，方斌；第十六、十七篇，陈孔常；第十八篇，金杏妹、刘纯山、吴海霞。

本书内容广泛，涉及到医药、农业、食品、染料、涂料、纺织、黏合剂、表面活性

剂、高分子材料、催化剂、石油工业、电子工业、信息材料、环境保护和与生命体相关的某些化学用品等多学科和工农业生产各领域。每篇分若干章，各章中的每条辞目均简要地介绍了成分、制备方法、应用范围、使用方法等。为便于读者查阅，书末还附有中、英文索引。

特别令人感动的是，要组织撰写篇幅这样大的著作是十分困难的。本书得以完成，是华东理工大学学校领导全力支持的结果。科学出版社张英娥同志为本书的选题、组稿、成书倾注了许多心血。我们对他们的支持和努力深致谢忱。

由于笔者受学识水平和视野所限，书中种种不足和缺点，恐是难免，恳请读者不吝赐教。

莫述诚 钱旭红
2000.10 于北京

第一篇 医 药

第一章 概 论

古代的药物是从自然界的天然产物中得到的。有机化学的发展,使天然产物中许多有效成分的分离、精制、结构测定和人工合成变成了现实。相关化合物与衍生物的合成及药理试验,使药物用品迅速发展。人们陆续从合成产物中发现并合成了各种麻醉剂、消毒剂、血管扩张剂、解热镇痛剂、镇静与催眠剂、维生素、激素和各种其他的化学治疗药物。

目前所使用的药物,大多按药效分类,例如可分为以下几种:

麻醉性药物,包括:全身或局部麻醉用药物;骨骼肌松弛药;抗胆碱酯酶药等。

中枢神经系统药物,包括:催眠、镇静、抗惊厥和抗癫痫药物;抗精神病药物;解热、镇痛药物等。

心脑血管及相关疾病的药物,包括:血管收缩或舒张剂;抗心律失常或抗心绞痛药剂;血脂调节药物等。

抗肿瘤及免疫调节剂,包括:各类抗肿瘤制剂(例如烷化剂、抗代谢剂等);免疫增强剂和免疫抑制剂等。

抗菌及抗病毒类药物,包括:抗生素类药物,如青霉素族、头孢菌素族、四环素族、氨基甙类、大环内酯类、多肽类、林可霉素类、氯霉素类以及其他各类抗生素;磺胺类药物;喹诺酮类药物;抗结核病药;抗麻风病药及其他各种抗菌及抗病毒药物。

呼吸系统及消化系统药物,包括:止咳祛痰剂,平喘剂;抗酸剂;平滑肌松弛剂;助消化药,泻药及止泻药;呕吐剂和止吐剂;舒肝利胆药物等。

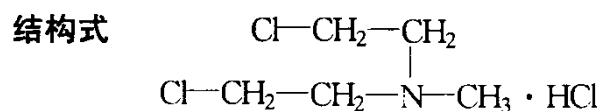
激素类药物,包括:性激素制剂,甲状腺激素调节剂,肾上腺类激素,血糖调节药物等。

此外,还有抗寄生虫药物,血液及造血系统药物,体液盐水平衡调节药物,维生素类药物,生化及生物制剂(例如疫苗等),诊断性药剂,消毒剂等各种功效繁多的制剂。

本篇所论及的,仅限于精细化工领域的典型制品。

第二章 抗肿瘤药物

1.2.1 盐酸氮芥(氮芥) (Chlormethinum)

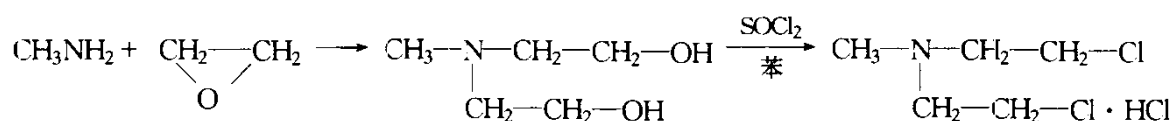


化学式 $\text{C}_5\text{H}_{12}\text{NCl}_3$

相对分子质量 192.52

物化性质 白色片状结晶。熔点 $108\sim 111^\circ\text{C}$ 。极易溶于水,易溶于乙醇,水溶液极易分解。

制备方法 以伯胺为原料,与过量的环氧乙烷在低温下作用,生成双-(β -羟乙基)-胺类化合物,再以氯化亚砷或其他氯化剂在有机溶剂中(如苯、氯仿等)进行氯化即得。



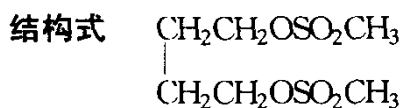
用途及实例 能直接作用于对细胞具有重要意义的生化物质——DNA 分子的亲核中心并以共价键形成交联,使其失去活性;或破坏 DNA 双螺旋间的氢键,使 DNA 分子断裂。是一种强烈的细胞毒素,主要用于恶性淋巴瘤和蕈样肉芽肿瘤以及肺癌,对其他肿瘤如卵巢癌、乳腺癌、绒癌、前列腺癌、精原细胞瘤

和鼻咽癌等也有一定疗效。抗瘤谱较广,但选择性差,对增殖细胞和非增殖细胞的作用近似。静、动脉或腔内注射,每次 0.1mg/kg,每日或隔日一次,4~6 次为一疗程,必要时休息 4 周再进行第二疗程。

安全性和防护 具有高毒性。危规号:2,2199D。

包装与贮运 塑料薄膜外加金属桶包装,避光、密封保存。

1.2.2 白消安(马利兰) (Busulfan)

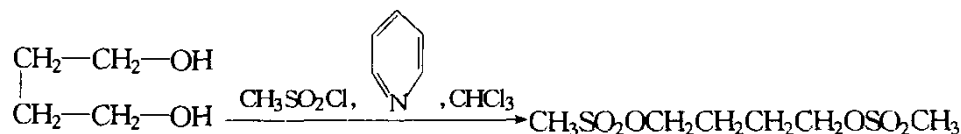


化学式 $\text{C}_6\text{H}_{14}\text{O}_6\text{S}_2$

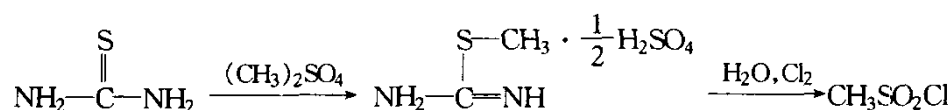
相对分子质量 246.31

物化性质 白色结晶性粉末,几乎无臭。熔点 115~118℃。不溶于水,溶于丙酮,微溶于乙醇。

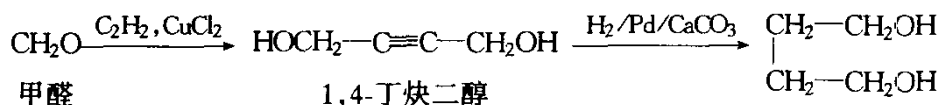
制备方法 由 1,4-丁二醇与甲磺酰氯缩合而得。甲磺酰氯可由硫脲经甲基化和氯氧化而得。



(1) $\text{CH}_3\text{SO}_2\text{Cl}$ 的制备



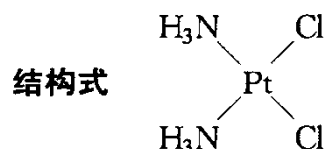
(2) 1,4-丁二醇的制备



用途及实例 本品为细胞周期非特异性药物,主要作用于 G_1 期和 M 期。其作用原理与氮芥相仿。本品低剂量抑制骨髓粒细胞的生成,对红细胞和淋巴细胞几乎无影响。大剂量时对红细胞和淋巴细胞的生成起抑制作用。由于选择性作用,对慢性粒细胞白血病疗效显著,对其他肿瘤疗效不明显。口服:成人每日 4~8mg,待白细胞降至 10 000 左右时,停药或改用维持量 1~3mg,每日服 1 次或每周服 2 次。

包装与贮运 密封,在干燥处保存。

1.2.3 顺氯氨铂(顺-双氯双氨络铂) (Cisplatin)



化学式 $\text{H}_6\text{Cl}_2\text{N}_2\text{Pt}$

相对分子质量 300.06

物化性质 橙黄色或黄色结晶性粉末、无臭。熔点 268~272℃(分解)。微溶于水,易溶于二甲基甲酰胺。在水溶液中可逐渐转化成反式和水解。

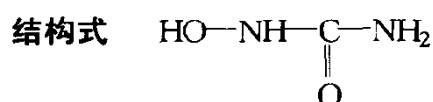
制备方法 由四氯铂酸钾($\text{K}_2[\text{PtCl}_4]$)与氯化铵、氨水络合制得。



用途及实例 本品用于急性淋巴白血病、淋巴瘤、恶性葡萄胎、绒癌、宫颈癌和成骨肉瘤等。白血病,每日口服 0.1mg/kg,一般需 3~4 周见效。肌注每周 2 次,每次 20~25mg。绒毛膜上皮癌,每日静注 10~20mg,5d 为一疗程。鞘内注射,每次 10~15mg。

包装与贮运 遮光,密封保存。

1.2.4 羟基脲(氨甲酰基胺) (Hydroxyurea)

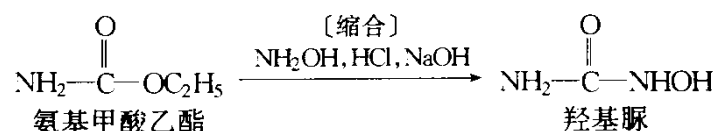


化学式 $\text{CH}_4\text{O}_2\text{N}_2$

相对分子质量 76.06

物化性质 白色或类白色针状结晶,无臭,无味。熔点 133~136℃(分解)。易溶于水或热乙醇,微溶于冷乙醇,不溶于乙醚。

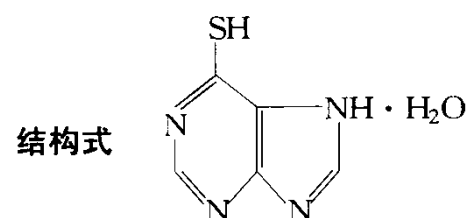
制备方法



用途及实例 本品主要用于治疗慢性粒细胞白血病。口服每日 60~80mg/kg,每周 2 次,以 6 周为一疗程,或间歇疗法,每次 60mg/kg,每 8h 一次,给药 24h,间歇 4~7d,再进行第二疗程。

包装与贮运 在干燥阴凉处,密闭保存。

1.2.5 巯嘌呤(乐疾宁) (Mercaptopurine)

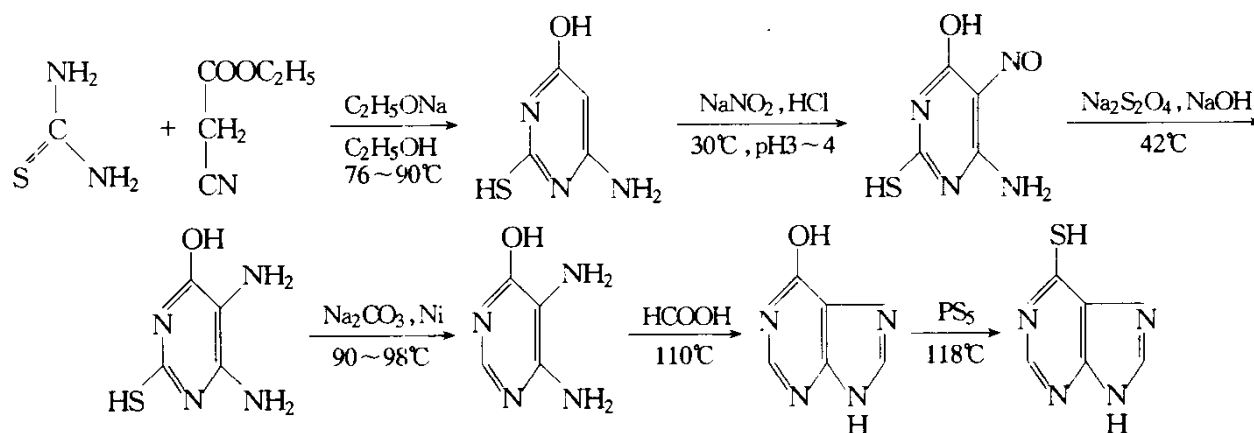


化学式 $\text{C}_5\text{H}_4\text{N}_4\text{S} \cdot \text{H}_2\text{O}$

相对分子质量 170.20

物化性质 微黄色结晶性粉末,味微甜。熔点 313~314℃(分解)。极微溶于水,稍溶于沸水,几乎不溶于乙醚或乙醇,易溶于碱性水溶液。

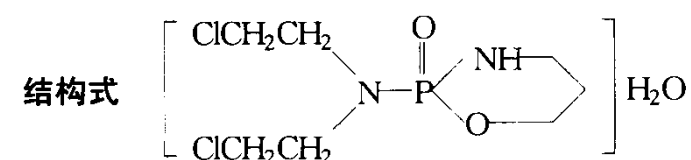
制备方法 硫脲在乙酸钠存在下,与氰乙酸乙酯缩合得 2-巯基-4-氨基-6-羟基嘧啶,亚硝化得 2-巯基-4-氨基-5-亚硝基-6-羟基嘧啶,再在碱性中用连二亚硫酸钠(保险粉)还原得 2-巯基-4,5-二氨基-6-羟基嘧啶,在碳酸钠溶液中以活性镍催化脱硫得 4,5-二氨基-6-羟基嘧啶,与甲酸缩合得次黄嘌呤,在吡啶中以五硫化磷转变为巯嘌呤。



用途及实例 本品能抑制核糖核酸转变成脱氧核糖核酸,从而抑制 DNA 合成。其毒性较低,起效迅速,能长期服用。本品主要作用于 S 期,对 G_1/S 边界有延缓作用,从而待细胞同步化,集中 G_1 期,此期对放射线敏感,与放疗结合应用可提高疗效。主要用于治疗慢性粒细胞白血病。口服每日 60~80mg/kg,每周 2 次,以 6 周为一疗程,或应用间歇疗法,每次 60mg/kg,每 8h 一次,给药 24h,间歇 4~7 d,再进行第二疗程。

包装与贮运 在干燥阴凉处,密闭保存。

1.2.6 环磷酰胺(安道生) (Cyclophosphamide)

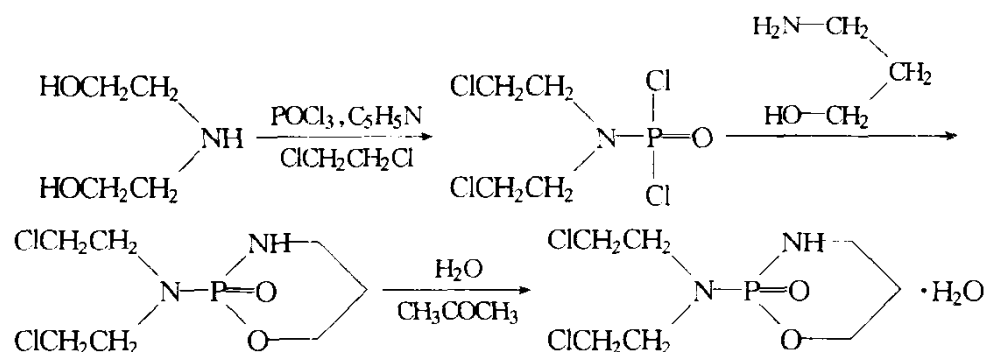


化学式 $\text{C}_7\text{H}_{15}\text{O}_2\text{N}_2\text{Cl}_2\text{P} \cdot \text{H}_2\text{O}$

相对分子质量 279.10

物化性质 白色结晶或结晶性粉末,无臭,味微苦。熔点 48.5~52℃。易溶于乙醇,溶于水或丙酮,水溶液不稳定。

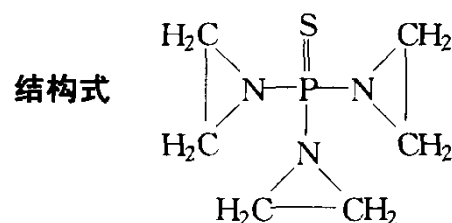
制备方法 以二乙醇胺为原料,在无水吡啶中,用过量的三氯氧磷同时进行氯化 and 磷酸化,直接转化为氮芥磷酸二氯再在二氯乙烷中与 3-氨基丙醇缩合即得。



用途及实例 本品未被代谢时,无烷基化活性,对组织无直接损害作用。其代谢物之一为醛磷酸胺,在癌组织中很快分解成磷酸胺氮芥,此产物对癌组织毒化作用强,发挥其选择性抗癌作用。本品用于恶性淋巴瘤效果好,对急性淋巴白血病也具一定疗效,其他对慢性淋巴细胞白血病、乳癌、卵巢癌、睾丸癌、多发性骨髓瘤、神经性细胞瘤、头颈部癌和结肠癌等也有效。本品有免疫抑制作用,用于肾病综合症和类风湿性关节炎等。每日服 3mg/kg,分二次服。静注成人每次 200mg,每日或隔日 1 次;儿童每日 3~4mg/kg,或隔日 1 次。总量:成人一个疗程为 8~10g。

包装与贮运 避光密封,在 30℃ 以下保存。

1.2.7 噻替派(三胺硫磷,塞替派) (Thiotepum)

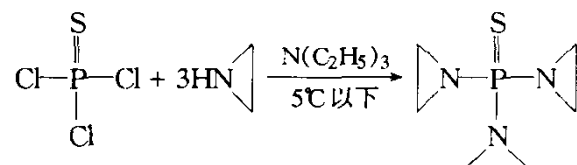


化学式 $C_6H_{12}N_3PS$

相对分子质量 189.22

物化性质 白色鳞片状结晶或结晶性粉末,无臭或几乎无臭。熔点 52~57℃。易溶于水、乙醇、乙醚或氯仿。

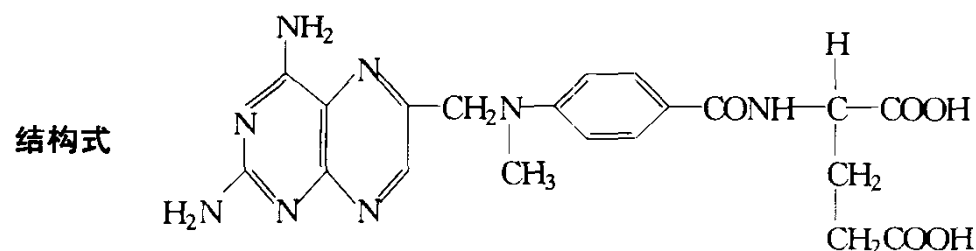
制备方法 本品可用硫氯化磷在三乙胺存在下,于无水苯中低温与乙烯亚胺缩合得粗品,用石油醚重结晶。



用途及实例 本品化学结构中的乙撑亚胺基能与细胞内 DNA 的核碱基,如与嘌呤结合,从而使 DNA 变性,影响癌细胞的分裂。本品为细胞周期非特异性药物。本品对乳腺癌和卵巢癌有较好的疗效。对消化道的腺癌、宫颈癌、甲状腺癌、肺癌和恶性黑色素瘤等也有一定疗效。肌注、静注每日每次 10mg,连用 5 d 后,改为每周 3 次,总量 200~300mg 为一疗程。动脉或局部灌注每日 1 次 10~20mg,总量同上。

包装与贮运 遮光,密闭保存。

1.2.8 甲胺喋呤(甲氨基叶酸) (Methotrexatum)

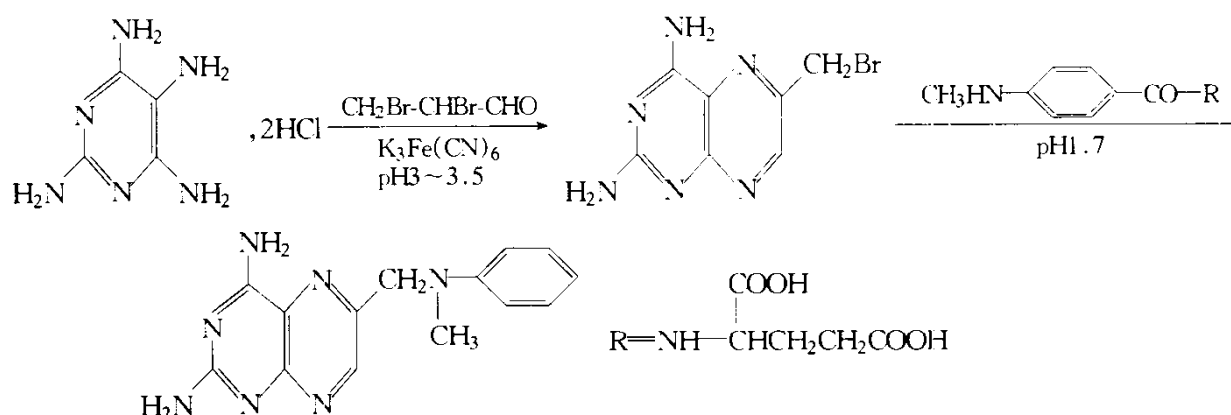


化学式 $C_{20}H_{22}O_5N_8$

相对分子质量 454.45

物化性质 橙黄色结晶性粉末。熔点 $185 \sim 194^\circ\text{C}$ 。几乎不溶于水、乙醇、氯仿或乙醚,易溶于稀碱、酸或碱金属的碳酸盐溶液,微溶于稀盐酸。

制备方法 用四氨基嘧啶双盐酸盐与 2,3-二溴丙醛环合得 6-溴甲基喋啶,最后在酸中与对甲胺基苯甲酰赖氨酸缩合即得。

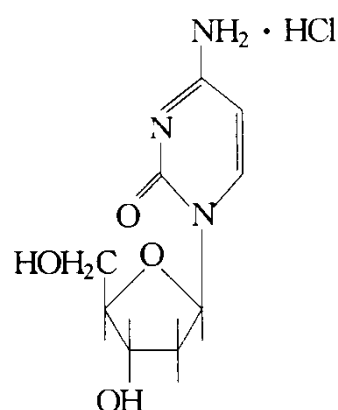


用途及实例 本品主要为二氢叶酸还原酶抑制剂,阻断脱氧胸苷酸和嘌呤核苷酸的生成,使 DNA 和 RNA 合成受阻碍,癌细胞生长受抑制。本品特异性地抑制 S 期细胞。生长比率高的细胞对甲氨喋呤的杀伤作用最敏感,较大剂量可使 S 期停止 48h 以上,并延缓 G_1 期进入 S 期。其作用可被四氢叶酸对抗,用于急性淋巴白血病、淋巴瘤、恶性葡萄胎、绒癌、鳞状上皮癌、肺癌、宫颈癌、乳腺癌和成骨肉瘤(大剂量)等。白血病,每日口服 $0.1\text{mg}/\text{kg}$,一般需 3~4 周见效。肌注每周 2 次,每次 $20 \sim 25\text{mg}$ 。绒毛膜上皮癌,每日静注 $10 \sim 20\text{mg}$,5 d 为一疗程,鞘内注射,每次 $10 \sim 15\text{mg}$ 。

包装与贮运 遮光,密封保存。

1.2.9 盐酸阿糖胞苷(阿糖胞苷) (Cytarabine Hydrochloride)

结构式

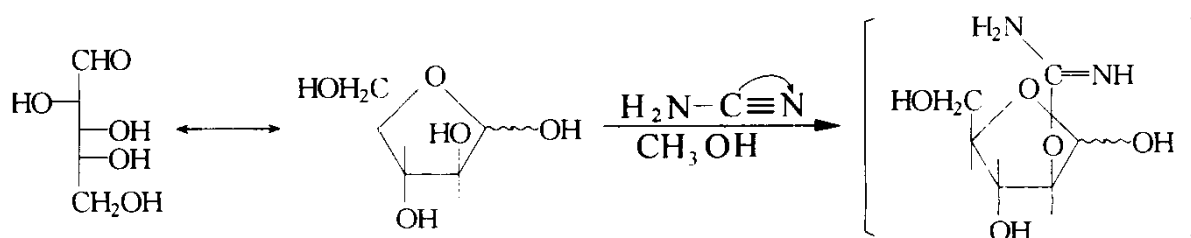


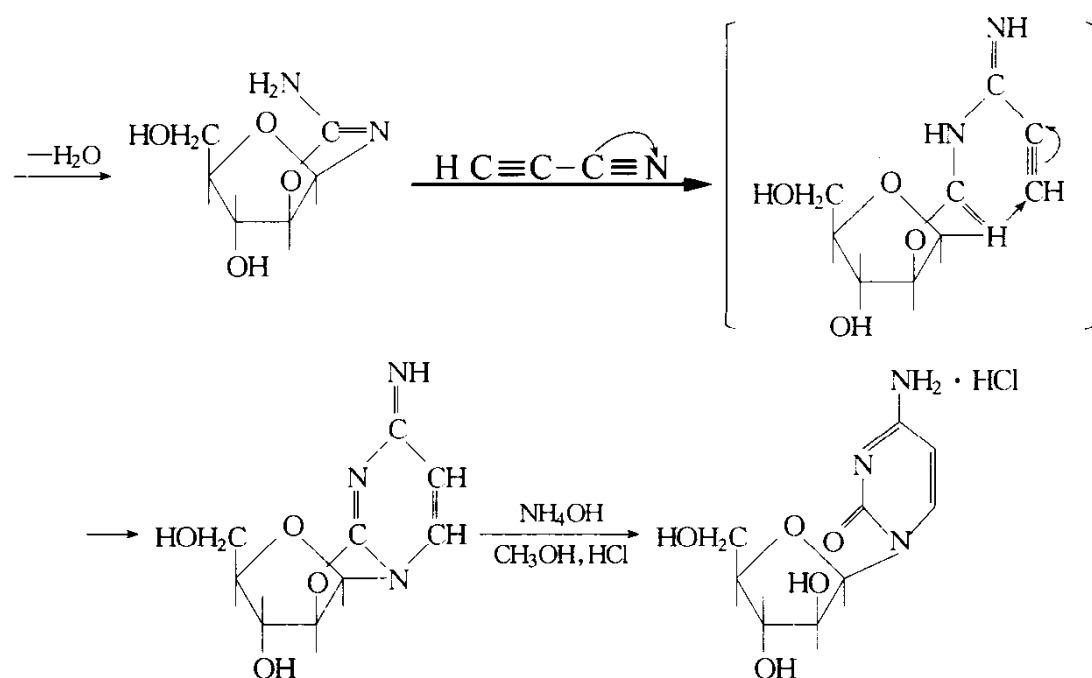
化学式 $C_9H_{13}O_5N_3 \cdot \text{HCl}$

相对分子质量 279.68

物化性质 白色细小针状结晶或结晶粉末,无臭。熔点 $190 \sim 195^\circ\text{C}$ (分解)。极易溶于水,略溶于乙酸,几乎不溶于乙醚。

制备方法 以 D-阿拉伯糖为原料,在甲醇中与氰胺作用,生成乙-胺基-D-阿糖嘧啶,再与丙炔腈反应,分子内环合生成环胞苷,以氨水处理再成盐即得。

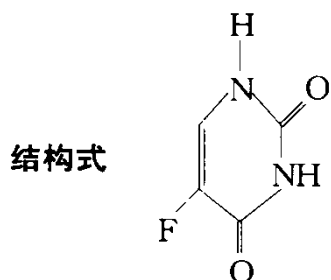




用途及实例 本品主要用于各类急性白血病(为急性粒细胞白血病首选治疗药物,与硫唑嘌呤合用较好)。静注,每日1次2mg/kg,连续10d。静滴,每日0.5~1mg/kg,连续10d给药。

包装与贮运 避光,严封,在冷处保存。

1.2.10 氟尿嘧啶(5-氟尿嘧啶) (Fluorouracil)

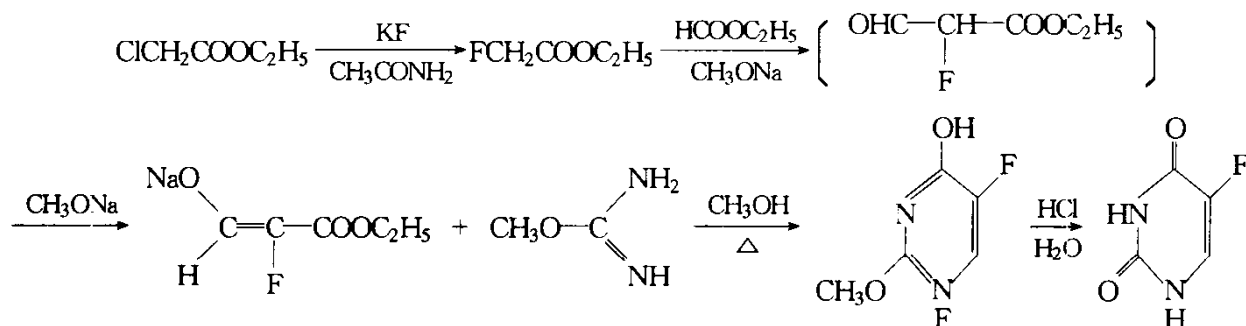


化学式 $C_4H_3O_2N_2F$

相对分子质量 130.08

物化性质 白色或类白色结晶或结晶性粉末。熔点281~284℃(分解)。略溶于水,微溶于乙醇,几乎不溶于氯仿,可溶于稀盐酸或氢氧化钠溶液。

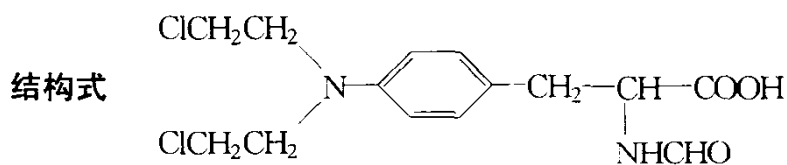
制备方法 以氯乙酸乙酯为原料,在乙酰胺中与无水氟化钾作用进行氟化,经分馏得氟乙酸乙酯。在甲苯中,以甲醇钠为缩合剂,与甲酸乙酯缩合得氟代甲酰乙酸乙酯烯醇型钠盐,再与甲基异脲缩合得2-甲氧基-4-羟基-5-氟嘧啶,最后用稀盐酸水解即得。



用途及实例 本品用于消化系统癌、头颈部癌、妇科癌症、肺癌、肝癌、膀胱癌、胰腺癌和皮肤癌等。口服,每日150~300mg,分3次;静注,每次10mg/kg,一般每次500mg,每周2次,直至出现毒性反应。静脉滴注,每日15~30mg/kg,每次滴注时间不得少于6~8h,10d为一疗程,静注和静脉滴注前均应称体重,准确计算剂量。

包装与贮运 避光,密封保存。

1.2.11 N-甲酰溶肉瘤素(氮甲) (Formyl Merphalan)

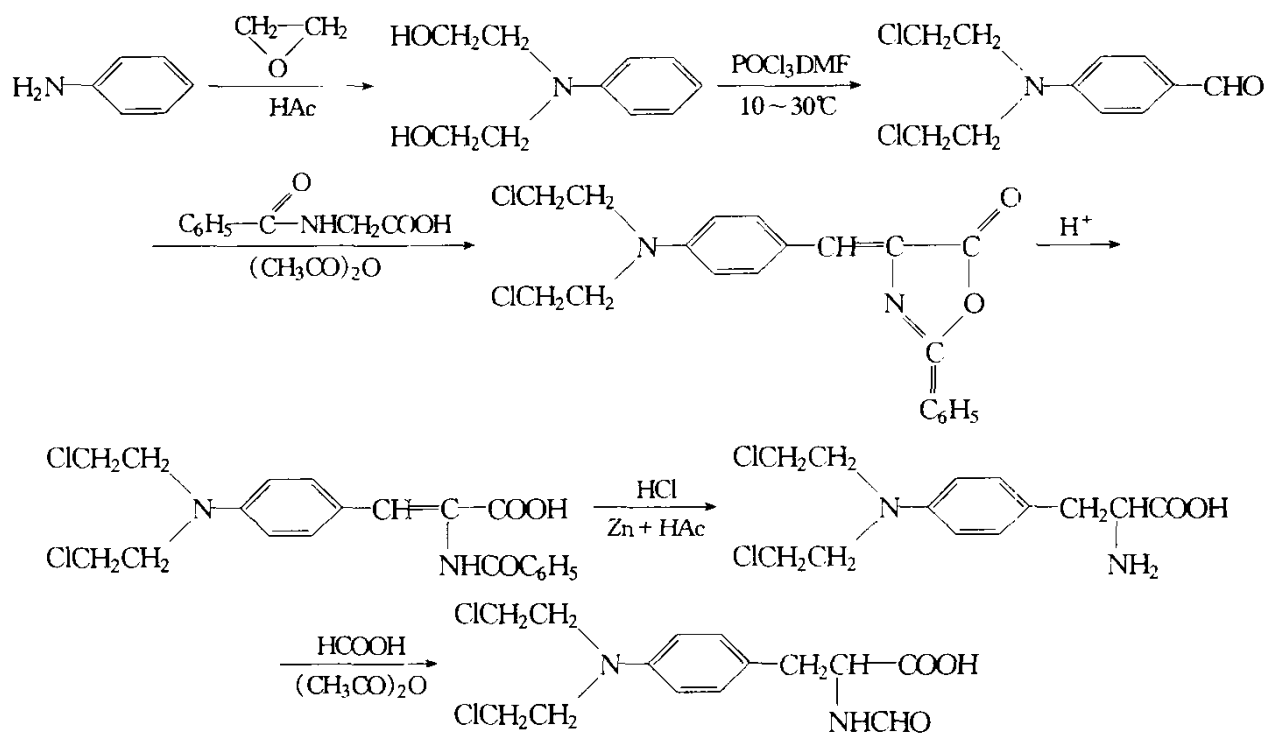


化学式 $C_{14}H_{18}O_3N_2Cl_2$

相对分子质量 333.21

物化性质 白色或淡黄色结晶性粉末,遇光变色。熔点 $150 \sim 155^{\circ}\text{C}$ 。不溶于水、略溶于乙醇,微溶于丙酮。

制备方法 以苯胺为原料,与环氧乙烷在醋酸中作用,得双-苯胺,用三氯氧磷和 DMF 于低温下进行 Vilsmeier 反应。同时氯化得苯甲醛氮芥,与马尿酸缩合得苯甲醛氮芥噁唑酮,用锌粉在冰醋酸和盐酸中,同时进行还原和水解得溶肉瘤素,最后在醋酐中,以甲酸甲酰化即得。

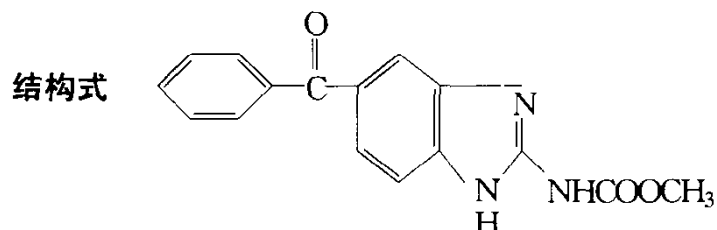


用途及实例 本品对多发性骨髓瘤和精原细胞瘤有较突出的疗效,对恶性淋巴瘤也有明显疗效。口服,成人每日 $150 \sim 200\text{mg}$ ($3 \sim 4\text{mg/kg}$),分 3~4 次或睡前 1 次服用,6~8g 为一疗程。

包装与贮运 避光,密封保存。

第三章 抗寄生虫病药物

1.3.1 甲苯咪唑 (Mebendazole)



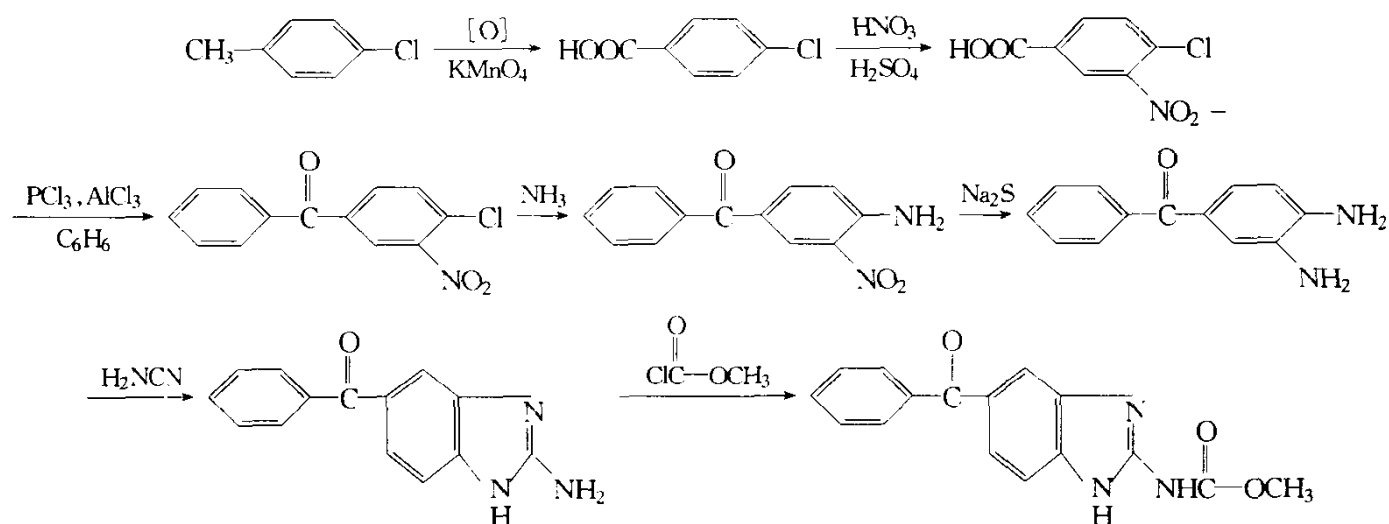
化学式 $C_{16}H_{13}O_3N_2$

相对分子质量 281.29

物化性质 白色或微黄色极细粉末,无臭,无味,不吸湿,在空气中稳定。熔点 $285 \sim 287^{\circ}\text{C}$ 。几乎不溶于水、醇、醚及氯仿,易溶于甲酸及苯甲醛、冰醋酸,微溶于二甲亚砜。

制备方法 以对氯甲苯为原料,经氧化及硝化反应得 3-硝基-4-氯苯甲酸,再经氯化、Friedel-Crafts 反应,制得 3-硝基-4-氯二苯酮,经胺化及还原反应得 3,4-二氨基二苯酮,再与脒胺反应生成 5(6)-苯甲酰基苯

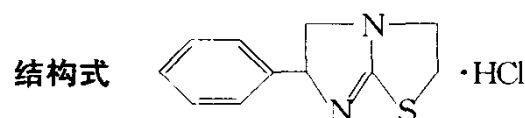
并咪唑-2-氨基,最后与氯代碳酸甲酯缩合即得。



用途及实例 本品对于蛔、蛲、鞭、钩等多种肠道蠕虫均有效。抑制虫体对葡萄糖的摄取,导致糖元耗竭,影响蠕虫的生长繁殖。使其活动逐渐减弱,最后死亡。对人的血糖无影响。对于鞭、蛲、蛔、钩虫感染均有较高的治愈率,为首选抗鞭虫药物。治疗鞭、蛔、钩虫感染,每日早晚各服 100mg,连服 3d。如未治愈,3 周后进行第二疗程。治疗绦虫感染,每次服 300mg,每日 2 次,连服 3d。

包装与贮运 避光,密封保存。

1.3.2 盐酸左旋咪唑 (Levamisole Hydrochloride)

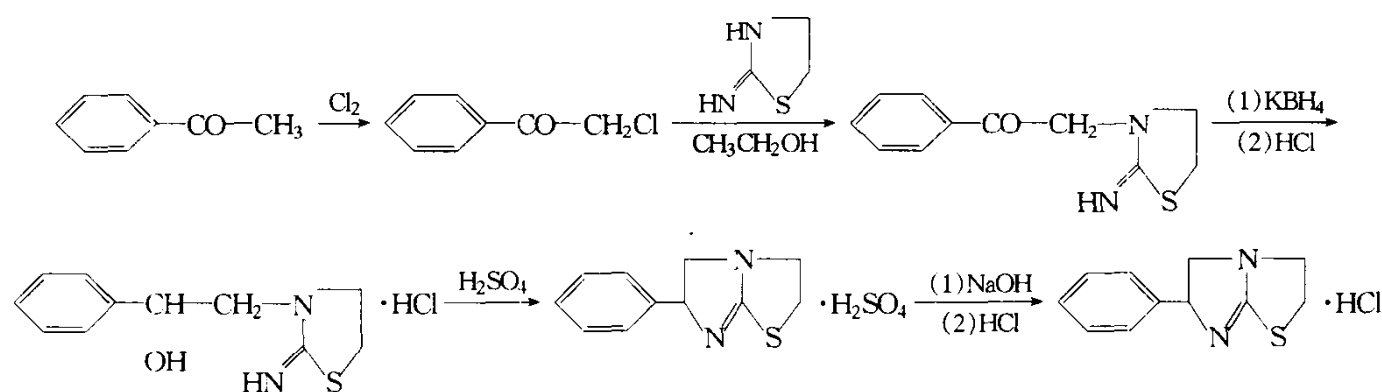


化学式 $C_{11}H_{12}N_2S \cdot HCl$

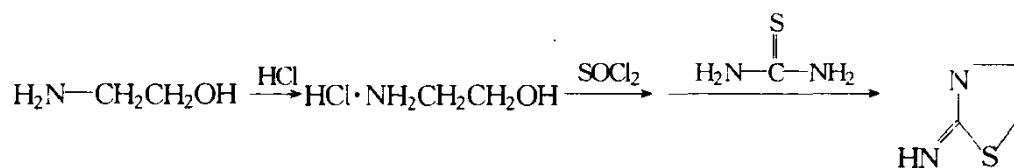
相对分子质量 240.75

物化性质 白色或微黄色结晶性粉末,无臭,味苦。极易溶于水,易溶于乙醇,微溶于氯仿,极微溶于丙酮。熔点 $225 \sim 230^\circ C$,比旋光度 $-120^\circ \sim -127^\circ$ 。

制备方法 以苯乙酮为原料经氯化反应生成 α -氯化苯乙酮,再与 α -氨基噻唑啉缩合得 2-亚氨基-3-苯甲酰甲基噻唑啉盐酸盐,经硼氢化钾还原及成盐得 α -亚氨基-3-(α -羟基苯乙基)-噻唑啉盐酸盐。经浓硫酸脱水环合、碱化得四咪唑,最后用盐酸酸化即得。



2-氨基噻唑啉是以氨乙醇为原料经成盐酸盐、氯化与硫脲环合而得。



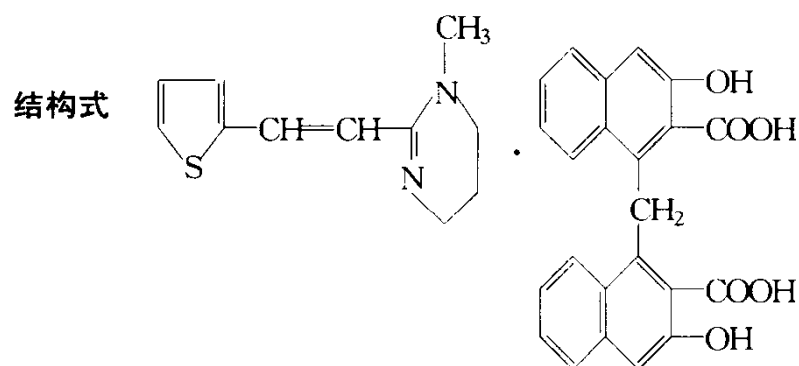
用途及实例 本品为广谱驱虫药,其活性为消旋体的两倍,毒性及副作用也较低。左旋咪唑抗蛔虫作用较好,口服单剂量的抗蛔虫疗效可达 $90\% \sim 100\%$,对钩虫、蛲虫也有明显抗虫作用。适于集体治疗。左旋咪唑能使蛔虫肌肉麻痹后,随粪便排出体外。实验证明,它能选择性地抑制虫体肌肉中的琥珀酸脱氢酶,使延胡索酸不能还原为琥珀酸,从而影响虫体肌肉的无氧代谢,减少能量的产生。但对哺乳动物的

琥珀酸脱氢酶并无影响。本品又是免疫调节剂,可使细胞免疫力原来较低者得到恢复,但不会将正常免疫力过度提升。提高细胞免疫力功能可能与其提高淋巴细胞内的环鸟苷酸相对水平有关。

本品可用于原发性免疫缺陷病,小儿继发性免疫缺陷而致呼吸道反复感染。第Ⅰ期肺癌手术后加用本品可延迟及减少复发。本品用于一些自身免疫性疾病,如类风湿性关节炎等,可能是恢复抑制性胸腺淋巴细胞(TS)功能,从而抑制产生自身抗体的骨髓淋巴细胞(BL)而奏效。抗蛔虫:口服,成人每日1.5~2.5mg/kg,半空腹顿服;儿童每日2~3mg/kg。抗钩虫:口服,每次服1.5~2.5mg,每晚1次,连服3d。抗丝虫:口服,每日4~8mg/kg,分2~3次服,连服2~3d。用于增强免疫:每2周用药3d,每次50mg,每日2~3次;或每周用药2次,每次50mg,每日2次。治疗自身免疫性疾病和增强免疫的用法及用量相同,或连续每日用药,每次50mg,每日2~3次。

包装与贮运 密闭保存。

1.3.3 双羟萘酸噻嘧啶 (Pyrantel Pamoate)

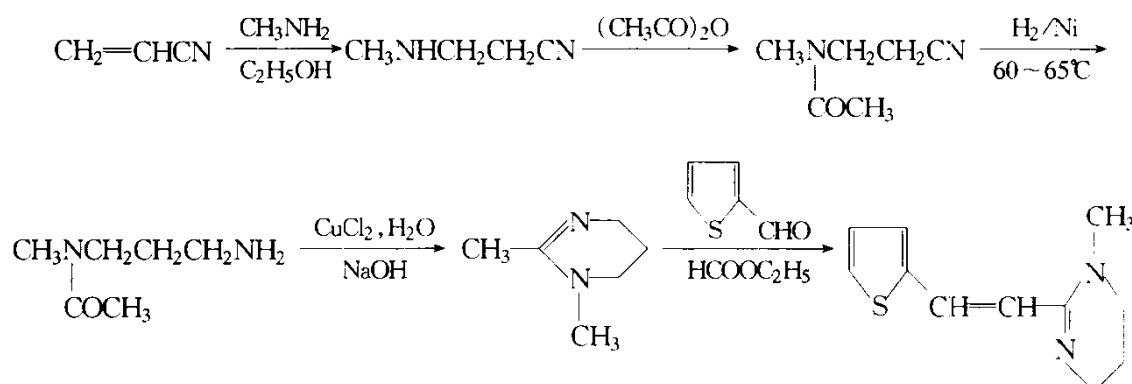


化学式 $C_{11}H_{14}N_2S \cdot C_{23}H_{16}O_6$

相对分子质量 594.69

物化性质 淡黄色粉末,无味无臭。不溶于水、甲醇、醚及氯仿,微溶于乙醇,易溶于吡啶。熔点 262~266℃(分解)。

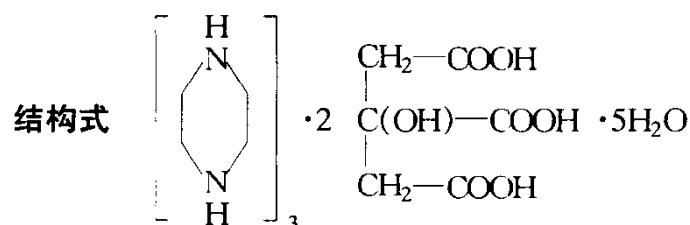
制备方法 以丙烯腈为原料,先与甲胺加成,经乙酰化、催化氢化、环合反应得 2-甲基-1,4,5,6-四氢嘧啶。再与 2-醛基噻吩在甲酸乙酯溶液中缩合得噻嘧啶,最后与甲撑双羟萘酸成盐。



用途及实例 本品为对蛔虫、钩虫和蛲虫都有效的广谱抗肠虫药。它通过抑制胆碱酯酶,使虫体肌肉强烈收缩并导致痉挛性麻痹,使虫体不能附着于肠壁,但不引起蛔虫骚动。其治疗量对人体该酶无影响。常用于治疗蛲虫、蛔虫、钩虫。抗蛔虫:成人剂量,每日口服1.2~1.5g,顿服;抗钩虫:对十二指肠钩虫,每日口服1.5g,顿服,对美洲钩虫,每日1.5g,顿服,连服3d。抗钩虫联合用药,双羟萘酸噻嘧啶,每日0.3g,盐酸左旋咪唑,每日50mg,顿服。抗蛲虫:每日1.5g,顿服,连服3d,第一疗程两周后,进行第二疗程。儿童剂量,30mg/kg,睡前一次顿服。

包装与贮运 遮光,密闭保存。

1.3.4 枸橼酸哌嗪 (Piperazine Citrate)

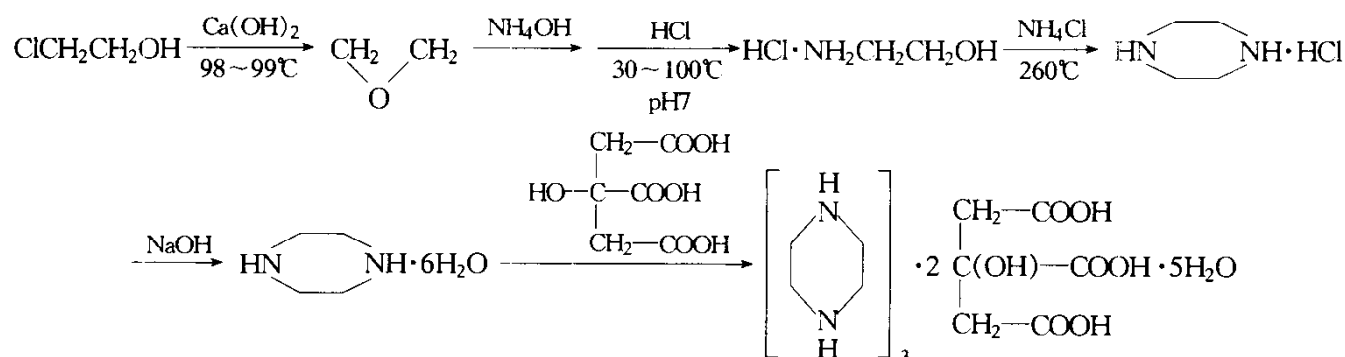


化学式 $(C_4H_{10}N_2)_3 \cdot 2C_6H_8O_7 \cdot 5H_2O$

相对分子质量 732.75

物化性质 白色结晶性粉末,无臭,味酸,微有吸湿性。易溶于水,极微溶于甲醇,不溶于乙醇、氯仿、乙醚及苯。熔点 $182 \sim 187^\circ\text{C}$ 。

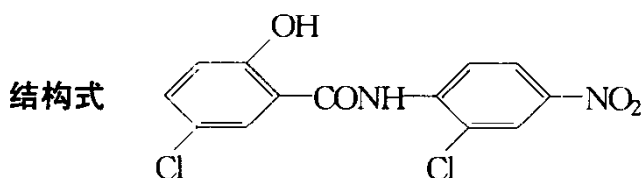
制备方法 以氯乙醇为原料,环化生成环氧乙烷,再经氨化、盐酸化生成盐酸氨基乙醇,然后环合、中和生成六水哌嗪,最后与枸橼酸成盐即得。



用途及实例 哌嗪是一种安全而有效的抗蛔虫和抗蛲虫药。它能麻痹蛔虫,使虫体不能附着于宿主肠壁,随肠蠕动而排出。原因在于它能减弱乙酰胆碱对蛔虫肌肉的兴奋作用。临床上用于抗蛔虫,对蛔虫感染有良效;对蛔虫所致的小肠梗阻或早期胆道蛔虫病,于疼痛缓解后应用也有效。抗蛔虫:成人口服,每次 $3 \sim 3.5\text{g}$,每日 1 次;儿童每次口服 $0.1 \sim 0.16\text{g/kg}$,每日 1 次,每日剂量不超过 3g ,连服 2 d。抗蛲虫:成人每次口服 $1 \sim 1.2\text{g}$,口服 2 次,连服 7~10d;儿童每次口服 30mg/kg ,每日 2 次,剂量每日不超过 2g ,连服 7~10d。

包装及贮运 遮光,密闭保存。

1.3.5 氯硝柳胺 (Niclosamide)

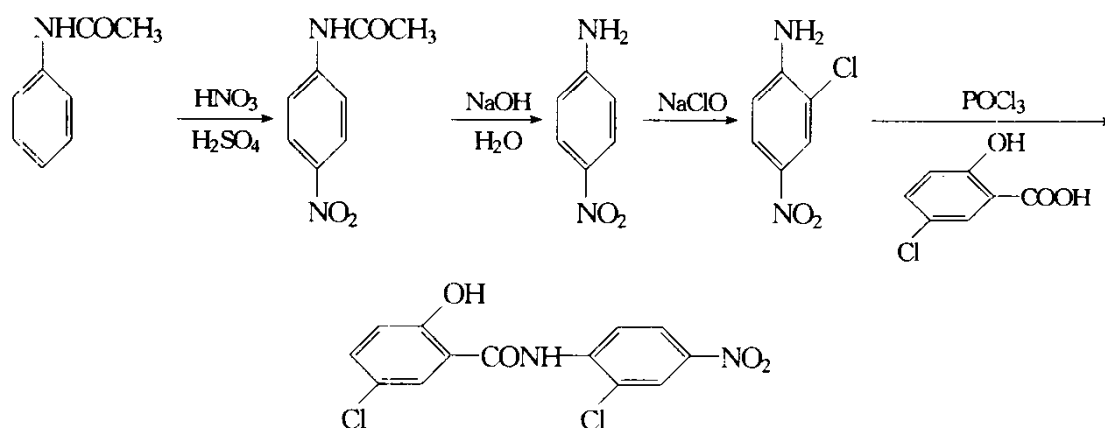


化学式 $C_{13}H_8O_4Cl_2N_2$

相对分子质量 327.13

物化性质 灰黄色结晶性粉末,无臭无味,不溶于水,微溶于乙醇、氯仿。溶于热乙醇、环己酮及氢氧化钠溶液。熔点 $225 \sim 230^\circ\text{C}$, 233°C 分解。

制备方法 以乙酰苯胺为原料,经硝化、水解及氯化制得 2-氯-4-硝基苯胺,然后在三氯氧磷存在下与 5-氯水杨酸缩合即得。



用途及实例 本品对猪肉绦虫、牛肉绦虫及短膜壳绦虫都有较好的杀虫作用。其与虫体接触后,绦虫头节和近端节片即被杀死,绦虫因头节脱离肠壁而被排出体外,或被肠蛋白酶分解。本品的杀虫机理可能为抑制绦虫线粒体氧化磷酸化过程,抑制绦虫对氧和葡萄糖的摄入,使糖原分解增加和乳酸脱氢酶的活性受抑制。

本品对日本血吸虫尾蚴和钉螺也有杀灭作用。本品口服后难吸收,主要从粪中排泄,仅有 $20\% \sim$

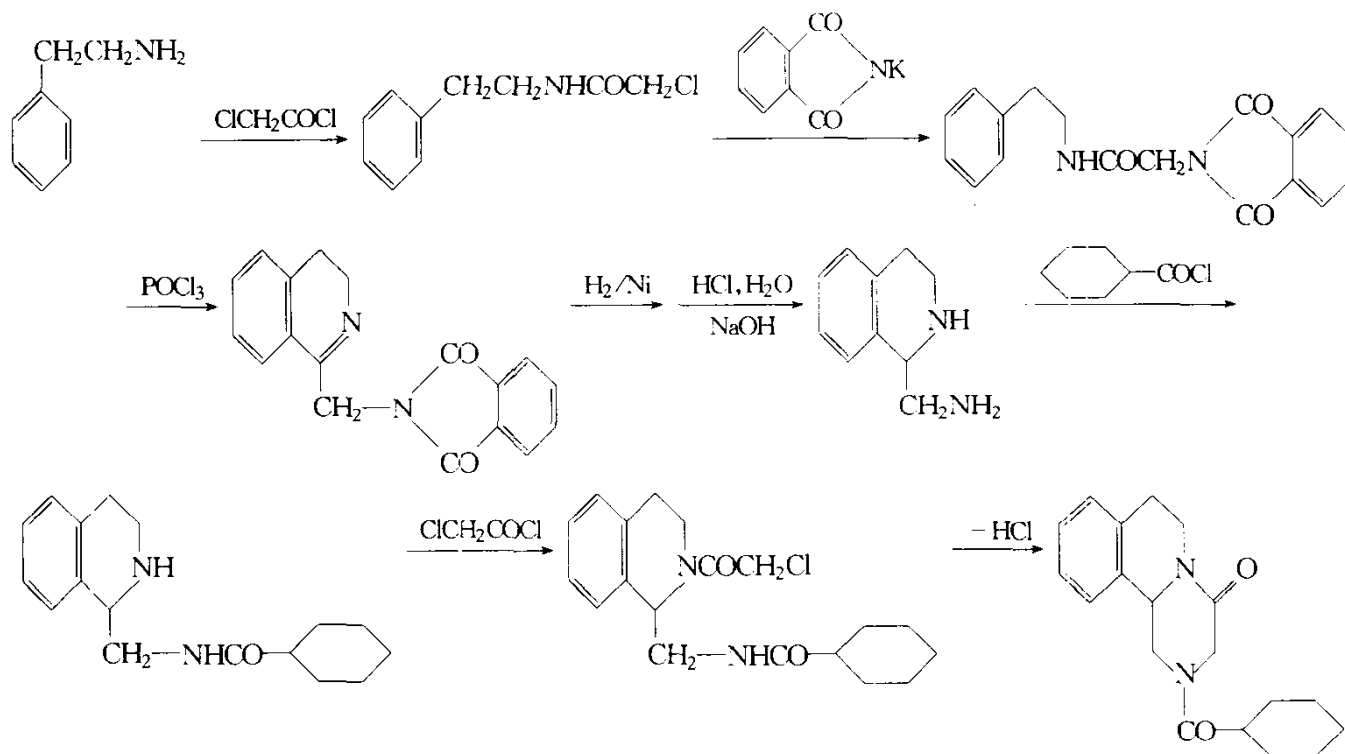
包装与贮运 遮光,密封保存。

结构式

O=C1CCCCN1C2=CN3C(=O)N(C3c4ccccc4)CC2

相对分子质量 312.42

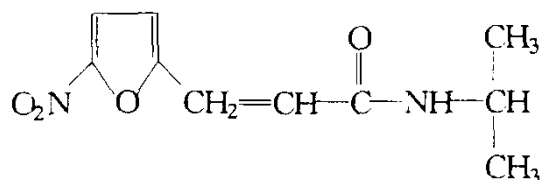
制备方法 以苯乙胺为原料,经氯乙酰化后,与苯二甲酰亚胺钾缩合生成 N-苯二甲酰亚胺乙酰基苯乙胺,然后在三氯氧磷作用下脱水环合成 3,4-二氢异喹啉衍生物,再经氢化、酸性水解得 1-氨基甲基四氢异喹啉,再经环己甲酰化及氯乙酰化,最后脱氯化氢环合即得。



包装与贮运 遮光,密闭保存。

1.3.7 呋喃丙胺 (Fura Promide)

结构式

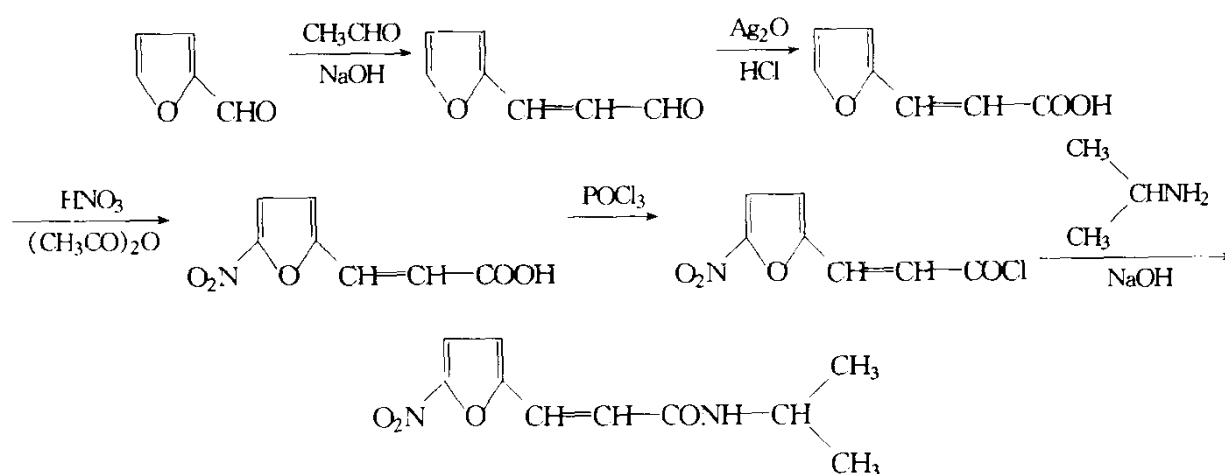


化学式 $C_{10}H_{12}O_4N_2$

相对分子质量 224.22

物化性质 淡黄色鳞片状结晶,无臭无味,露置日光下色渐变深。不溶于水,略溶于丙酮或氯仿,微溶于乙醇。熔点 $189 \sim 193^\circ\text{C}$ 。

制备方法 以呋喃甲醛为原料,与乙醛缩合生成呋喃丙烯醛,经氧化成呋喃丙烯酸,再经硝化、酰氯化及胺解即得。

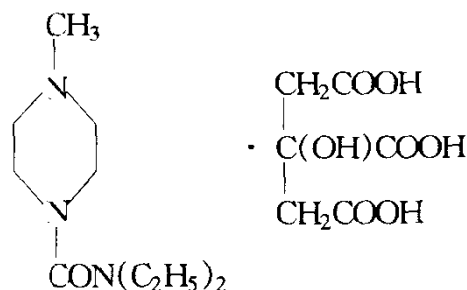


用途及实例 本品对血吸虫成虫、童虫及虫卵均有杀死作用。因呋喃丙胺能杀死组织内各发育阶段的虫卵,所以对急性血吸虫病发热有明显退热及控制症状的作用。虫受药作用后糖元含量明显减少和消失,虫体麻痹,随血流入肝脏,最后变性虫体被宿主细胞包围消灭。临床用于治疗急性血吸虫病、慢性早期血吸虫病,亦可用于晚期血吸虫病伴有发热,但无黄疸、腹水且肝功能尚好的患者。对姜片虫感染亦有较好的疗效。抗血吸虫:成人口服,每次 20mg/kg , 日服 3 次,连服 $14 \sim 20\text{d}$; 儿童口服,每次 20mg/kg , 日服 4 次,疗程相同。抗姜片虫:成人口服,日服 $1 \sim 2\text{g}$,连服 2d 。

包装与贮运 遮光,密闭保存。

1.3.8 枸橼酸乙胺嗪 (Diethyl Carbazine Citrate)

结构式

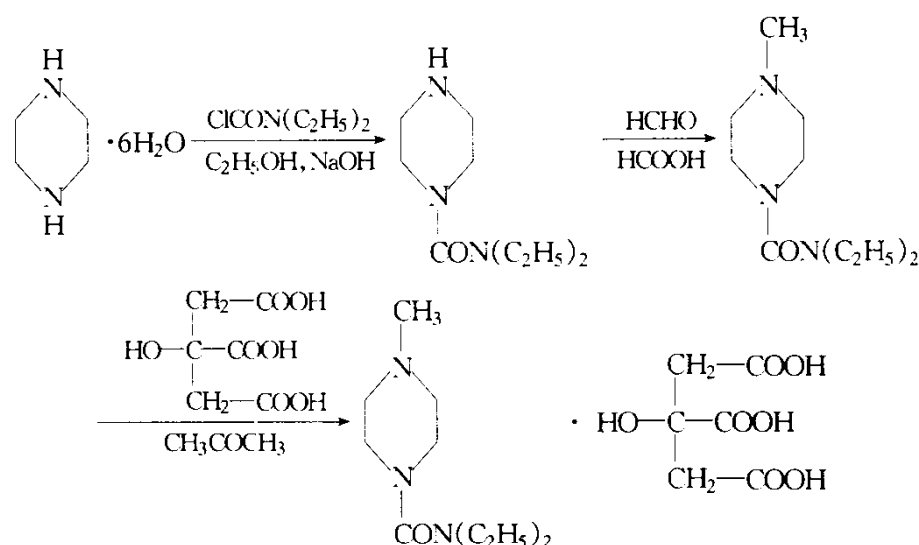


化学式 $C_{10}H_{21}ON_3 \cdot C_6H_8O_7$

相对分子质量 391.43

物化性质 白色结晶性粉末,无臭,味酸苦,微有引湿性。易溶于水,略溶于乙醇,不溶于丙酮、氯仿或乙醚。熔点 $135 \sim 138^\circ\text{C}$ 。

制备方法 以六水哌嗪为原料经二乙胺基甲酰化、甲基化制得 1-二乙胺基甲酰-4-甲基哌嗪,最后在丙酮中与枸橼酸成盐即得。

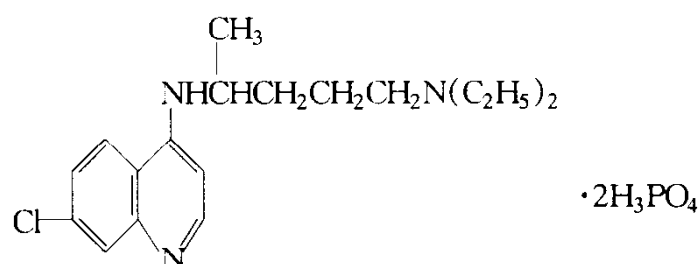


用途及实例 本品对微丝蚴及成虫均有作用,以对微丝蚴作用最强。其作用并不能直接杀死微丝蚴,而是改变其性质,使易受网状内皮系统清除。本品体外无杀死微丝蚴的作用,用药后,血中微丝蚴迅速集中到肝脏的微血管中,经一段时间即被吞噬细胞所消灭。微丝蚴死亡所释放的大量异体蛋白,常可引起高热等过敏反应。本品对斑氏丝虫和马来丝虫病病人用足量及长疗程治疗可杀死成虫,但成虫死亡时导致局部组织反应。临床用于丝虫病的治疗与预防。成人口服,每次 0.1~0.2g,每日 3 次,7~14d 一个疗程,采用 2 个疗程,间隔 1~2 月。马来丝虫病,成人口服 1~1.5g,顿服,或每次 0.75g,口服 2 次,一日为一疗程,可服 2~3 疗程,间隔 1 个月以上。斑氏丝虫病,成人口服,总剂量 3g 的 3d 或 5d 疗法,或 4.5g 的 7d 疗法。可服 2~3 疗程,间隔 1 个月以上。将本品拌入食盐内食用可预防丝虫病。

包装与贮运 密封,干燥处保存。

1.3.9 磷酸氯喹 (Chloroquine Phosphate)

结构式

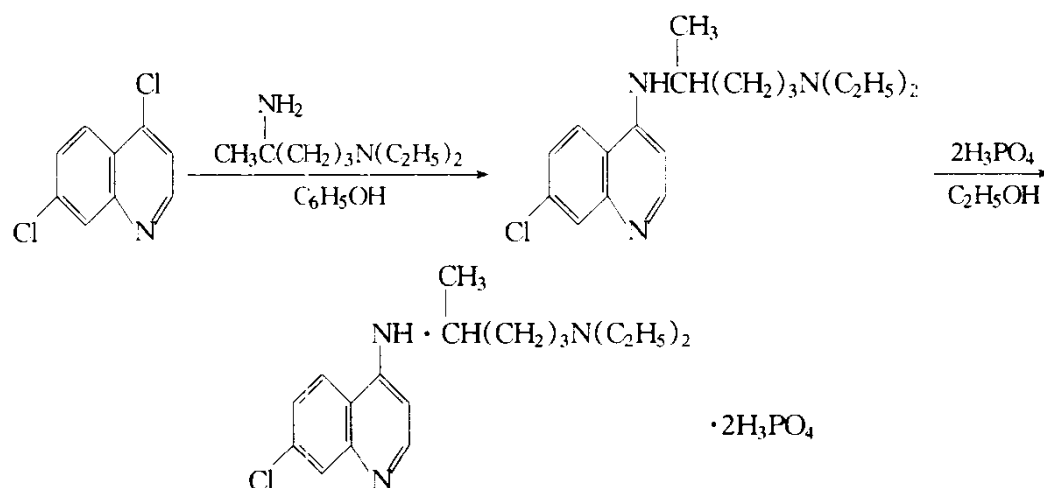


化学式 $C_{18}H_{26}N_3Cl \cdot 2H_3PO_4$

相对分子质量 515.88

物化性质 白色结晶性粉末,无臭,味苦,遇光渐变色。易溶于水,不溶于乙醇、氯仿、乙醚或苯。熔点 192~195℃(分解)。

制备方法 以 4,7-二氯喹啉为原料,与 4-二乙氨基-4-氨基戊烷在苯酚存在下脱氯化氢缩合得氯喹,最后以乙醇为溶剂与磷酸成盐即得。



用途及实例 本品主要作用于红血球内期的疟原虫,能有效地控制恶性疟原及间日疟的临床症状,是治疗症状发作最有效的药物。其特点是作用快、效力强、作用持久。氯喹凭其喹啉环上带负电性的氯原子